### VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEI AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERMITTL **BOETERS & BAUER** INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHTS z.H. Forstmeyer, Dietmar Bereiteranger 15 D-81541 München (Regel 44.1 PCT) EINGEGANGEN **GERMANY** - 1. Juni 2001 **BOETERS & BAUER** Patentanwäite Absendedatum (Tag/Monat/Jahr) 01/06/2001 Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts WEITERES VORGEHEN 11012-rb siehe Punkte 1 und 4 unten Internationales Aktenzeichen Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) PCT/EP 00/08118 20/08/2000 Anmelder PROBIODRUG GESELLSCHAFT ... 1. [X] Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß der internationale Recherchenbericht erstellt wurde und ihm hiermit übermittelt wird. Einreichung von Änderungen und einer Erklärung nach Artikel 19: Der Anmelder kann auf eigenen Wunsch die Ansprüche der internationalen Anmeldung ändern (siehe Regel 46): Bis wann sind Änderungen einzureichen? Die Frist zur Einreichung solcher Änderungen beträgt üblicherweise zwei Monate ab der Übermittlung des internationalen Recherchenberichts; weitere Einzelheiten sind den Anmerkungen auf dem Beiblatt zu entnehmen. Wo sind Änderungen einzureichen? Unmittelbar beim Internationalen Büro der WIPO, 34, CHEMIN des Colombettes, CH-1211 Genf 20, Telefaxnr.: (41-22) 740.14.35 Nähere Hinweise sind den Anmerkungen auf dem Beiblatt zu entnehmen. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß kein internationaler Recherchenbericht erstellt wird und daß ihm hiermit die Erklärung nach Artikel 17(2)a) übermittelt wird. Hinsichtlich des Widerspruchs gegen die Entrichtung einer zusätzlichen Gebühr (zusätzlicher Gebühren) nach Regel 40.2 wird dem Anmelder mitgeteilt, daß der Widerspruch und die Entscheidung hierüber zusammen mit seinem Antrag auf Übermittlung des Wortlauts sowohl des Widerspruchs als auch der Entscheidung hierüber an die Bestimmungsämter dem Internationalen Büro übermittelt worden noch keine Entscheidung über den Widerspruch vorliegt; der Anmelder wird benachrichtigt, sobald eine Entscheidung getroffen wurde. 4. Weiteres Vorgehen: Der Anmelder wird auf folgendes aufmerksam gemacht: Kurz nach Ablauf von 18 Monaten seit dem Prioritätsdatum wird die internationale Anmeldung vom Internationalen Büro veröffentlicht. Will der Anmelder die Veröffentlichung verhindern oder auf einen späteren Zeitpunkt verschieben, so muß gemäß Regel 90 by bzw. 90 s. vor Abschluß der technischen Vorbereitungen für die internationale Veröffentlichung eine Erklärung über die Zurücknahme der internationalen Anmeldung oder des Prioritätsanspruchs beim Internationalen Büro eingehen. Innerhalb von 19 Monaten seit dem Prioritätsdatum ist ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung einzureichen, wenn der Anmelder den Eintritt in die nationale Phase bis zu 30 Monaten seit dem Prioritätsdatum (in manchen Ämtern sogar noch länger)

Innerhalb von 20 Monaten seit dem Prioritätsdatum muß der Anmelder die für den Eintritt in die nationale Phase vorgeschriebenen Handlungen vor allen Bestimmungsämtern vornehmen, die nicht innerhalb von 19 Monaten seit dem Prioritätsdatum in der Anmeldung oder einer nachträglichen Auswahlerklärung ausgewählt wurden oder nicht ausgewählt werden konnten, da für sie

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040

Fax: (+31-70) 340-3016

Kapitel II des Vertrages nicht verbindlich ist.

Bevollmächtigter Bediensteter

Geertruida Groeneveld-Van der Spek

verschieben möchte.

#### ANMERKUNGEN ZU FORMBLATT PCT/ISA/220

Diese Anmerkungen sollen grundlegende Hinweise zur Einreichung von Änderungen gemäß Artikel 19 geben. Diesen Anmerkungen liegen die Erfordernisse des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens (PCT), der Ausführungsordnung und der Verwaltungsrichtlinien zu diesem Vertrag zugrunde. Bei Abweichungen zwischen diesen Anmerkungen und der verwaltungsrichtlinien zu diesem Vertrag zugrunde. Bei Abweichungen zwischen diesen Anmerkungen und der obengenannten Texten sind letztere maßgebend. Nähere Einzelheiten sind dem PCT-Leitfaden für Anmelder, einer Veröffentlichung der WIPO, zu entnehmen.

Die in diesen Anmerkungen verwendeten Begriffe "Artikel", "Regel" und "Abschnitt" beziehen sich jeweils auf die Bestimmungen des PCT-Vertrags, der PCT-Ausführungsordnung bzw. der PCT-Verwaltungsrichtlinien.

#### HINWEISE ZU ÄNDERUNGEN GEMÄSS ARTIKEL 19

Nach Erhalt des internationalen Recherchenberichts hat der Anmelder die Möglichkeit, einmal die Ansprüche der internationalen Anmeldung zu ändern. Es ist jedoch zu betonen, daß, da alle Teile der internationalen Anmeldung (Ansprüche, Beschreibung und Zeichnungen) während des internationalen vorläufigen Prüfungsverfahrens geändert werden können, normalerweise keine Notwendigkeit besteht, Änderungen der Ansprüche nach Artikel 19 einzureichen, außer wenn der Anmelder z.B. zum Zwecke eines vorläufigen Schutzes die Veröffentlichung dieser Ansprüche wünscht oder ein anderer Grund für eine Änderung der Ansprüche vor ihrer internationalen Veröffentlichung vorliegt. Weiterhin ist zu beachten, daß ein vorläufiger Schutz nur in einigen Staaten erhältlich ist.

#### Welche Teile der internationalen Anmeldung können geändert werden?

Im Rahmen von Artikel 19 können nur die Ansprüche geändert werden,

In der internationalen Phase können die Ansprüche auch nach Artikel 34 vor der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde geändert (oder nochmals geändert) werden. Die Beschreibung und die Zeichnungen können nur nach Artikel 34 vor der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde geändert werden.

Beim Eintritt in die nationale Phase können alle Teile der internationalen Anmeldung nach Artikel 28 oder gegebenenfalls Artikel 41 geändert werden.

#### Bis wann sind Änderungen einzureichen?

Innerhalb von zwei Monaten ab der Übermittlung des internationalen Recherchenberichts oder innerhalb von sechzehn Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft. Die Änderungen gelten jedoch als rechtzeitig eingereicht, wenn sie dem Internationalen Büro nach Ablauf der maßgebenden Frist, aber noch vor Abschluß der technischen Vorbereitungen für die internationale Veröffentlichung (Regel 46.1) zugehen.

#### Wo sind die Änderungen nicht einzureichen?

Die Änderungen können nur beim Internationalen Büro, nicht aber beim Anmeldeamt oder der Internationalen Recherchenbehörde eingereicht werden (Regel 46.2).

Falls ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung eingereicht wurde/wird, siehe unten.

#### in welcher Form können Änderungen erfolgen?

Eine Änderung kann erfolgen durch Streichung eines oder mehrerer ganzer Ansprüche, durch Hinzufügung eines oder mehrerer neuer Ansprüche oder durch Änderung des Wortlauts eines oder mehrerer Ansprüche in der eingereichten Fassung.

Für jedes Anspruchsblatt, das sich aufgrund einer oder mehrerer Änderungen von dem ursprünglich eingereichten Blatt unterscheidet, ist ein Ersatzblatt einzureichen.

Alle Ansprüche, die auf einem Ersatzblatt erscheinen, sind mit arabischen Ziffern zu numerieren. Wird ein Ansprüche gestrichen, so brauchen, die anderen Ansprüche nicht neu numeriert zu werden. Im Fall einer Neunumerierung sind die Ansprüche fortlaufend zu numerieren (Verwaltungsrichtlinien, Abschnitt 205 b)).

Die Änderungen sind in der Sprache abzufassen, in der dieinternationale Anmeidung veröffentlicht wird.

#### Weiche Unterlagen sind den Änderungen beizufügen?

#### Begleitschreiben (Abschnitt 205 b)):

Die Änderungen sind mit einem Begleitschreiben einzureichen.

Das Begleitschreiben wird nicht zusammen mit der internationalen Anmeldung und den geänderten Ansprüchen veröffentlicht. Es ist nicht zu verwechseln mit der "Erklärung nach Artikel 19(1)" (siehe unten, "Erklärung nach Artikel 19 (1)").

Das Begleitschreiben ist nach Wahl des Anmelders in englischer oder französischer Sprache abzufassen. Bei englischsprachigen Internationalen Anmeldungen ist das Begleitschreiben aber ebenfalls in englischer, bei französischsprachigen Internationalen Anmeldungen in französischer Sprache abzufassen.



### ANMERKUNGEN ZU FORMBLATT PCT/ISA/220 (F rts tzung)

Im Begleitschreiben sind die Unterschiede zwischen den Ansprüchen in der eingereichten Fassung und den geänderten Ansprüchen anzugeben. So ist insbesondere zu jedem Anspruch in der internationalen Anmeldung anzugeben (gleichlautende Angaben zu verschiedenen Ansprüchen können zusammengefaßt werden), ob

- der Anspruch unverändert ist; i)
- der Anspruch gestrichen worden ist; ii)
- der Anspruch neu ist; Gü
- der Anspruch einen oder mehrere Ansprüche in der eingereichten Fassung ersetzt; iv)
- der Anspruch auf die Teilung eines Anspruchs in der eingereichten Fassung zurückzuführen ist. V)

## Im folgenden sind Beispiele angegeben, wie Änderungen im Begleitschreiben zu erläutem sind:

- [Wenn anstelle von ursprünglich 48 Ansprüchen nach der Änderung einiger Ansprüche 51 Ansprüche existieren]: Die Ansprüche 1 bis 29, 31, 32, 34, 35, 37 bis 48 werden durch geänderte Ansprüche gleicher Numerierung ersetzt; Ansprüche 30, 33 und 36 unverändert; neue Ansprüche 49 bis 51 hinzugefügt.
- 2. [Wenn anstelle von ursprünglich 15 Ansprüchen nach der Änderung aller Ansprüche 11 Ansprüche existieren]: "Geänderte Ansprüche 1 bis 11 treten an die Stelle der Ansprüche 1 bis 15."
- 3. [Wenn ursprünglich 14 Ansprüche existierten und die Änderungen darin bestehen, daß einige Ansprüche gestrichen werden und Ansprüche 1 bis 6 und 14 unverändert; Ansprüche 7 bis 13 gestrichen; neue Ansprüche 15, 16 und 17 hinzugefügt. "Oder" Ansprüche 7 bis 13 gestrichen; neue Ansprüche 15, 16 und 17 hinzugefügt; alle übrigen Ansprüche unverändert.
- [Wenn verschiedene Arten von Änderungen durchgeführt werden]:
  "Ansprüche 1-10 unverändert; Ansprüche 11 bis 13, 18 und 19 gestrichen; Ansprüche 14, 15 und 16 durch geänderten Anspruch 14 ersetzt; Anspruch 17 in geänderte Ansprüche 15, 16 und 17 unterteilt; neue Ansprüche 20 und 21 hinzugefügt."

### "Erklärung nach Artikel 19(1)" (Regel 46.4)

Den Änderungen kann eine Erklärung beigefügt werden, mit der die Änderungen erläutert und ihre Auswirkungen auf die Beschreibung und die Zeichnungen dargelegt werden (die nicht nach Artikel 19 (1) geändert werden können).

Die Erklärung wird zusammen mit der internationalen Anmeldung und den geänderten Ansprüchen veröffentlicht.

### Sie ist in der Sprache abzufassen, in der die internationalen Anmeldung veröffentlicht wird.

Sie muß kurz gehalten sein und darf, wenn in englischer Sprache abgefaßt oder ins Englische übersetzt, nicht mehr als 500 Wörter umfassen

Die Erklärung ist nicht zu verwechseln mit dem Begleitschreiben, das auf die Unterschiede zwischen den Ansprüchen in der eingereichten Fassung und den geänderten Ansprüchen hinweist, und ersetzt letzteres nicht. Sie ist auf einem gesonderten Blatt einzureichen und in der Überschrift als solche zu kennzeichnen, vorzugsweise mit den Worten \*Erklärung nach Artikel 19 (1)\*.

Die Erklärung darf keine herabsetzenden Außerungen über den inter nationalen Recherchenbericht oder die Bedeutung von in dem Bericht angeführten Veröffentlichungen enthalten. Sie darf auf im internationalen Recherchenbericht angeführte Veröffentlichungen, die sich auf einen bestimmten Anspruch beziehen, nur im Zusammenhang mit einer Änderung dieses Anspruchs Bezug nehmen.

### Auswirkungen eines bereits gestellten Antrags auf internationalevorläufige Prüfung

lst zum Zeitpunkt der Einreichung von Änderungen nach Artikel 19 bereits ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt worden, so sollte der Anmelder in seinem Interesse gleichzeitig mit der Einreichung der Anderungen beim Internation alen Bûro auch eine Kopie der Änderungen bei der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragen Behörde einreichen (siehe Regel 62.2 a), erster Satz).

### Auswirkungen von Änderungen hinsichtlich der Übersetzung derinternationalen Anmeldung beim Eintritt in die nationale Phase

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß bei Eintritt in die nationale Phase möglicherweise anstatt oder zusätzlich zu der Übersetzung der Ansprüche in der eingereichten Fassung eine Übersetzung der nach Artikel 19 geänderten Ansprüche an die bestimmten/ausgewählten Ämter zu übermitteln ist.

Nähere Einzelheiten über die Erfordemisse jedes bestimmten/ausgewählten Amts sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

### VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## **PCT**

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 11012-rb		die Übermittlung des internationalen Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit ender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen	Internationales Anmeldedatum	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
PCT/EP 00/08118	(Tag/Monat/Jahr) 20/08/2000	24/08/1999
Anmelder		
DDODYODDUG GEGELL CCHAFT		
PROBIODRUG GESELLSCHAFT	·	
Dieser internationale Recherchenbericht wur Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Ir Dieser internationale Recherchenbericht umf	_	erstellt und wird dem Anmelder gemäß
	weils eine Kopie der in diesem Bericht genannte	en Unterlagen zum Stand der Technik bei.
Grundlage des Berichts		
a. Hinsichtlich der Sprache ist die inte	ernationale Recherche auf der Grundlage der int gereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nicht	ternationalen Anmeldung in der Sprache s anderes angegeben ist.
Die internationale Recherc Anmeldung (Regel 23.1 b)	he ist auf der Grundlage einer bei der Behörde e ) durchgeführt worden.	eingereichten Übersetzung der internationalen
Recherche auf der Grundlage des	en Anmeldung offenbarten <b>Nucleotid- und/ode</b> Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das	er Aminosāuresequenz ist die internationale
<u> </u>	eldung in Schriflicher Form enthalten ist.	
1 ==	tionalen Anmeldung in computerlesbarer Form e	ingereicht worden ist.
[	ch in schriftlicher Form eingereicht worden ist.	
1	ch in computerlesbarer Form eingereicht worder	
Die Erklärung, daß das na internationalen Anmeldung	chträglich eingereichte schriftliche Sequenzproto ı im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgel	okoll nicht über den Offenbarungsgehalt der egt.
Die Erklärung, daß die in d wurde vorgelegt.	omputerlesbarer Form erfaßten Informationen d	em schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen,
2. X Bestimmte Ansprüche ha	aben sich als nicht recherchierbar erwiesen (	siehe Feld I).
1	it der Erfindung (siehe Feld II).	•
Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfi	induna	
-	ngereichte Wortlaut genehmigt.	
) ==	er Behörde wie folgt festgesetzt:	
_		
5. Hinsichtlich der Zusammenfassung		
wurde der Wortlaut nach f Anmelder kann der Behör Recherchenberichts eine	•	Absendung dieses internationalen
6. Folgende Abbildung der Zeichnunger	n ist mit der Zusammenfassung zu veröffentliche	
wie vom Anmelder vorges	chlagen	X keine der Abb.
1 52	keine Abbildung vorgeschlagen hat.	
weil diese Abbildung die E	Erfindung besser kennzeichnet.	

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 00/08118

a. KLASSIF IPK 7	FIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES CO7K5/037 CO7K7/02 CO7D277/0 A61P3/00	04 A61K31/425 A61K	38/06
Nach der Int	ernationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klass	sifikation und der IPK	
	RCHIERTE GEBIETE		
Recherchier	ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole C07K A61K C07D	e)	an an ann an
Recherchier	te aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, sow	veit diese unter die recherchierten Gebiete	fallen
Während de	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Na	ame der Datenbank und evtl. verwendete	Suchbegriffe)
EPO-In	ternal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data	, BIOSIS	
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 95 34538 A (BORLOO MARIANNE JE ;GOOSSENS FILIP JOZEF ANNY (BE); I 21. Dezember 1995 (1995-12-21) Seite 14, Zeile 30 -Seite 15, Zei Anspruch 1	HAEME)	1,15
X	WO 95 15309 A (FERRING BV ; JENKINS PAUL D (GB); JONES D MICHAEL (GB); SZELKE MICH) 8. Juni 1995 (1995-06-08) Ansprüche; Beispiele 3,4		
P,A	DE 198 26 972 A (ANSORGE SIEGFRIE HALLE WITTENBERG (DE); UNIV MAGDE TECH) 23. Dezember 1999 (1999-12- Ansprüche; Beispiele	BURG	1
•			
}			- <del></del>
<u></u>			
	tere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu nehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie	
Besonden  'A' Veröffe aber f  'E' älteres Anme  'L' Veröffe scheir ander soll or ausge 'O' Veröffe eine E  'P' Veröffe dem t	n internationalen Anmeldedatum it worden ist und mit der ir zum Verständnis des der soder der ihr zugrundeliegenden utung; die beanspruchte Erfindung ichtet werden utung; die beanspruchte Erfindung keit beruhend betrachtet teiner oder mehreren anderen verbindung gebracht wird und in naheliegend ist in Patenttantilie ist		
Datum des	Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Re	ecnerchenbenants
2	23. Mai 2001	01/06/2001	
Name und	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl,	Bevollmächtigter Bediensteter Fuhr, C	
1	Fax: (+31-70) 340-3016	,, .	

1

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 00/08118

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

reia i	Bemerkungen zu den Anspruchen, die sich als nicht recherchierbar etwiesen naben (Fortsetzung von Funkt 2 auf blatt
Gemäß /	Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:
1. X	Ansprüche Nr. weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
	Soweit die Ansprüche 11-14-und 25-27 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt. Sie basiert auf den angeführten Wirkungen der Verbindungen/Zusammensetzungen.
2.	Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle Internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
з. 🔲	Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.
Feld II	Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)
Die inter	rnationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:
1, []	Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser
لــا	internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. [	Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
з. 🗌	Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4.	Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recher- chenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen er- faßt:
Bemeri	kungen hinsichtlich eines Widerspruchs  Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 00/08118

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokum		Datum der Veröffentlichung		tglied(er) der atentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9534538	Α	21-12-1995	AU	2790895 A	05-01-1996
4			EP	0764151 A	26-03-1997
•			US	6090786 A	18-07-2000
WO 9515309	Α	08-06-1995	AU	1113395 A	19-06-1995
			AU	8421998 A	12-11-1998
· 1			CA	2178066 A	08-06-1995
			CN	1141033 A	22-01-1997
*			CZ	9601595 A	15-01-1997
			EΡ	0731789 A	18-09-1996
			FI	962315 A	05-08-1996
			HU	76274 A	28-07-1997
			JP	9509921 T	07-10-1997
			NO	962269 A	30-07-1996
		•	PL	314838 A	30-09-1996
			US	6201132 B	13-03-2001
			US	5939560 A	17-08-1999
			ZA	9409525 A	02-08-1995
DE 19826972	Α	23-12-1999	KEIN	 IE	

### VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender:

MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN

PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

An:

Forstmeyer, Dietmar BOETERS & BAUER Bereiteranger 15 D-81541 München ALLEMAGNE

17. Nov. 2001
BOETERS & BAUER
Patentagy alter

PCT

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN PRÜFUNGSBERICHTS

(Regel 71.1 PCT)

Absendedatum

(Tag/Monat/Jahr)

16.11.2001

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts

J.

WICHTIGE MITTEILUNG

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08118

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 20/08/2000

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)

24/08/1999

Anmelder

PROBIODRUG GESELLSCHAFT ...

- 1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
- 2. Eine Kopie des Berichts wird gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
- 3. Auf Wunsch eines ausgewählten Amts wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.

#### 4. ERINNERUNG

Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro im Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Prüfungsbericht enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu den maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde

**)** 

Europäisches Patentamt D-80298 München

Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d

Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Gallego, A

Tel. +49 89 2399-8102



### VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## **PCT**

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

./.	en des	Allineiders oder Allwalis	WEITERES VORGEHEN		ung über die Übersendung des internationalen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationa	les Al	tenzeichen	Internationales Anmeldedatum(Ta	g/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag)
PCT/EP0	0/08	118	20/08/2000		24/08/1999
Internationa C07C237		entklassifikation (IPK) oder i	I nationale Klassifikation und IPK		·
Anmelder					
PROBIO	DRU	G GESELLSCHAFT			
			fungsbericht wurde von der mit e elder gemäß Artikel 36 übermitte		onalen vorläufigen Prüfung beauftragten
2. Diese	r BEF	RICHT umfaßt insgesamt	t 8 Blätter einschließlich dieses	Deckblatts.	•
ui B	nd/od ehörd	er Zeichnungen, die geä	indert wurden und diesem Beric chtigungen (siehe Regel 70.16 i	ht zugrunde l	tter mit Beschreibungen, Ansprüchen liegen, und/oder Blätter mit vor dieser t 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT)
3. Diese	r Beri	cht enthält Angaben zu f	folgenden Punkten:		
1	$\boxtimes$	Grundlage des Berichts	<b>S</b>		
	$\boxtimes$	Priorität			
111		Keine Erstellung eines	Gutachtens über Neuheit, erfind	lerische Tätiç	gkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
IV	$\boxtimes$	Mangelnde Einheitlichk	eit der Erfindung		•
٧	Ø		ig nach Artikel 35(2) hinsichtlich parkeit; Unterlagen und Erklärun		der erfinderischen Tätigkeit und der zung dieser Feststellung
VI	☒	Bestimmte angeführte	Unterlagen		
VII	$\boxtimes$	<del>-</del>	internationalen Anmeldung		
VIII	$\boxtimes$	Bestimmte Bemerkung	en zur internationalen Anmeldur	ng	
VIII	Ø	Bestimmte Bemerkung	en zur internationalen Anmeldur	ng	

Datum der Einreichung des Antrags	Datum der Fertigstellung dieses Berichts
12/03/2001	16.11.2001
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d	Vogt, T
Fax: +49 89 2399 - 4465	Tel. Nr. +49 89 2399 8477

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER **PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08118

I. G	rund	lage	des	Beri	chts
------	------	------	-----	------	------

1.	Auf eing	forderung nach Art	ikel 14 hin vorgelegt wurden, ge ihm nicht beigefügt, weil sie keil	neldung ( <i>Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine</i> elten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich ne Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):
	1-20	0	ursprüngliche Fassung	
	Pat	entansprüche, Nr	.:	
	1-14	4,20-27	ursprüngliche Fassung	
	15-	19	mit Telefax vom	03/10/2001
	Zei	chnungen, Blätter	r:	
	1/1		ursprüngliche Fassung	
2.	die	internationale Anm		Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern
		Bestandteile stand gereicht; dabei han		zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache
		die Sprache der Ü Regel 23.1(b)).	Übersetzung, die für die Zwecke	der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach
		die Veröffentlichu	ngssprache der internationalen	Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
			Übersetzung, die für die Zwecke 5.2 und/oder 55.3).	der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden
3.				nbarten <b>Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz</b> ist die es Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:
		in der internationa	alen Anmeldung in schriftlicher I	Form enthalten ist.
		zusammen mit de	er internationalen Anmeldung in	computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
		bei der Behörde r	nachträglich in schriftlicher Forn	eingereicht worden ist.
		bei der Behörde r	nachträglich in computerlesbare	r Form eingereicht worden ist.
				schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den ng im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
			ß die in computerlesbarer Form I entsprechen, wurde vorgelegt.	erfassten Informationen dem schriftlichen

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER **PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08118

4.	Aufg	grund der Änderunge	n sind folgende Unterlagen fortgefallen:	
		Beschreibung,	Seiten:	
		Ansprüche,	Nr.:	
		Zeichnungen,	Blatt:	
5. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprüngl eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).				
		(Auf Ersatzblätter, o beizufügen).	lie solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen;sie sind diesem Bericht	
6.		aige zusätzliche Ben ne Beiblatt	nerkungen:	
11.	Pric	orität		
1.		Dieser Bericht ist of angeforderte Unterl	nne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da folgende agen nicht innerhalb der vorgeschriebenen Frist eingereicht wurden:	
		☐ Abschrift der fr	üheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist.	
		☐ Übersetzung d	er früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist.	
2.			nne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da sich der als ungültig herausgestellt hat.	
		e Zwecke dieses Beri ebliche Datum.	chts gilt daher das obengenannte internationale Anmeldedatum als das	
3.		raige zusätzliche Ber he Beiblatt	nerkungen:	
			Irait dar Erfindung	
		ngelnde Einheitlich	r Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der	
1.		r die Auπorderung zu melder:	r Emschlankung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebunken nat der	
		die Ansprüche eing	eschränkt.	
		zusätzliche Gebühr	en entrichtet.	
		zusätzliche Gebühr	ren unter Widerspruch entrichtet.	
		weder die Ansprüc	ne eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.	
2	. 🛛	Die Behörde hat fe gemäß Regel 68.1	stgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung	

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER **PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08118

zusätzlicher Gebühren aufzufordern.

3.	Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3				
		erfüllt ist			
		aus folgenden Gründen nicht erf	üllt ist:		
4.		ner wurde zur Erstellung dieses B rnationalen Anmeldung durchgef		eine internat	ionale vorläufige Prüfung für folgende Teile der
	×	alle Teile.			
		die Teile, die sich auf die Ansprü	iche N	r. beziehen.	
V.	Be <sub>i</sub>	gründete Feststellung nach Art werblichen Anwendbarkeit; Unt	ikel 35 erlage	i(2) hinsichtli n und Erklär	ch der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der ungen zur Stützung dieser Feststellung
1.	Fes	ststellung			
	Ne	uheit (N)	Ja: Nein:	Ansprüche Ansprüche	Erfindung I & II
	Erf	inderische Tätigkeit (ET)	Ja: Nein:	Ansprüche Ansprüche	Erfindung I & II
	Ge	werbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Nein:	Ansprüche Ansprüche	Erfindung I & II
2.		terlagen und Erklärungen ehe Beiblatt			
V	l. Be	estimmte angeführte Unterlager	1		
1.	Ве	stimmte veröffentlichte Unterlage	n (Reg	jel 70.10)	
uı	nd/	oder			
2.	. Nie	cht-schriftliche Offenbarungen (R	egel 70	0.9)	
s	iehe	Beiblatt			
v	II R	estimmte Mängel der internatio	nalen	Anmeldung	

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist: siehe Beiblatt

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08118

### VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken: siehe Beiblatt

### I Änderungen (Regel 70 PCT).

Die Anmelderin hat die Beispiele 2 und 3 aus Dokument D2 per Disclaimer aus dem Anspruch 15 ausgeschlossen.

Diese Disclaimer sind erlaubt.

### II Priorität (Art. 8 PCT).

Der Prioritätsanspruch der derzeitigen Anmeldung zum Anmeldetag der deutschen Patenanmeldung 19940130.6 (24.08.1999) ist gültig.

### IV Einheitlichkeit der Erfindung (Regel 13 PCT).

Die nachfolgenden Gruppen von Ansprüchen werden identifiziert:

- A) Verbindungen der allgemeinen Formel A(B)-C, und deren Verwendung (Ansprüche 1-14), und
- B) Zusammensetzungen enthaltend eine Verbindung der algemeinen Formel A(B)-C und ein Adjuvans, und deren Verwendung (Ansprüche 15-27).

Aus den folgenden Gründen hängen diese Gruppen nicht so zusammen, daß sie eine einzige allgemeine erfinderische Idee verwirklichen (Regel 13.1 PCT):
Beide obengenannten Gruppen enthalten eine Verbindung der allgemeinen Formel A(B)-C. Aber die Definition von B im Anspruch 1 stimmt nicht mit der aus Anspruch 15 überein. Deshalb sind die in den Ansprüchen 1 und 15 definierten Verbindungen aus Anspruch 1 nicht identisch. Folglich liegt diesen Ansprüchen kein einheitliches erfinderisches Konzept zugrunde (Regel 13 PCT).

In den nachfolgenden Ausführungen wird deshalb auf Erfindung I (Ansprüche 1-14) und Erfindung II (Ansprüche 15-27) verwiesen.

### V Erklärung (Regel 66(2) PCT).

Gegenstand der derzeitigen Anmeldung.

Eine Verbindung der allgemeinen Formel A(B)-C, eine Zusammensetzung enthaltend eine Verbindung der allgemeinen Formel A(B)-C, und deren Verwendung in

Arzneimitteln für die topische Behandlung von Krankheiten, worin die Aktivität von DPP- IV eine Rolle spielt.

### Zitierte Dokumente (Regel 64(1) PCT).

D1: WO 95 34538 A. D2: WO 95 15309 A.

D1 veröffentlicht die Reinigung von DPP-IV und Inhibitoren für DPP-IV. Die Inhibitoren aus D1 sind C-terminal pyrrolidinmodifizierte Aminosäuren der allgemeinen Formel A-C. Der Unterschied zwischen den aus D1 bekannten Inhibitoren und den in der vorliegenden Anmeldung vorgestellten Inhibitoren liegt darin, daß die Seitenkette der Aminosäure nicht modifiziert ist.

In D2 handelt es sich um DPP-IV Inhibitoren mit der allgemein Formel A(B)-C. In den Beispielen 2 bis 4 werden die Aminosäure Glu, Lys und Thr angeführt, die sowohl am C-terminus mit einer Pyrroldingruppe sowie an der Seitenkette modifiziert sind. Desweiteren offenbart D2 mit den Verbindungen 55 und 125 glycinmodifizierte Verbindungen der Formel Glu(Gly)- Pyrrolidin und Lys(Gly)-Pyrrolidin. In Beispiel 2 wird eine Verbindung gezeigt, die innerhalb der Definition der allgemeinen Formel A(B)-C liegt.

### Neuheit (Art. 33(2) PCT).

### Erfindung I:

Die Verbindungen der Erfindung I sind gegenüber D1 und D2 als neu anzusehen.

### Erfindung II:

Die Beispiele 2 und 3 aus D2 sind per Disclaimer von dem Gegenstand des Anspruchs 15 ausgeschlossen worden. Der Gegenstand von Erfindung II ist daher als neu anzusehen.

### Erfinderische Tätigkeit (Art. 33(3) PCT).

### Erfindung I & II:

Es gibt in D1 und D2 keinerlei Hinweise für einen Fachmann darauf, wie er die bekannten Verbindungen anzupassen hat um die Wirkung in Arzneimittel, die ausschließlich für topische Anwendungen bestimmt sind, zu verbessern.

Die Anwesenheit einer erfinderischen Tätigkeit in den Erfindungen I und II wird bestätigt.

### Gewerbliche Anwendbarkeit (Art. 33(4) PCT).

Für die Beurteilung der Frage, ob die Gegenstände der vorliegenden Ansprüche 11-14 und 25-27 gewerblich anwendbar sind, gibt es in den PCT-Vertragsstaaten keine einheitlichen Kriterien. Die Patentierbarkeit kann auch von der Formulierung der Ansprüche abhängen. Das EPA beispielsweise erkennt den Gegenstand von Ansprüchen, die auf die medizinische Anwendung einer Verbindung gerichtet sind, nicht als gewerblich anwendbar an; es können jedoch Ansprüche zugelassen werden, die auf eine bekannte Verbindung zur erstmaligen medizinischen Anwendung und die Verwendung einer solchen Verbindung zur Herstellung eines Arzneimittels für eine neue medizinische Anwendung gerichtet sind.

### VI Zitierte Dokumenten (Regel 64(3) PCT).

D3: DE 198 26 972 A 23. Dezember 1999.

D3 offenbart DPP-IV Inhibitoren der Formel A(B)-C und deren Verwendung in Arzneimitteln. In den Ansprüchen 5-9 wird die Verwendung von Inhibitoren offenbart, die unter die Beschreibung des Anspruchs 15 der derzeitigen Anmeldung fallen (z.B. Nɛ-4- nitrobenzyloxycarbonyl-L-Lys-Thiazolidid).

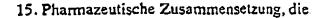
Deshalb ist D3 schädlich für die Neuheit der Ansprüche 15-27 (Erfindung II).

### VII Bemerkungen in bezug auf der Beschreibung (Art. 5, Regel 9 PCT).

Die Anmelderin hat vergessen einen offensichtlichen internen Vermerk aus der Beschreibung zu streichen '[Muß es hier nicht A heißen?)' (S. 7, Z. 6).

### VIII Bemerkungen in bezug auf die Ansprüche (Art. 6 PCT).

Patentansprüche 2-4, 6 und 20 werden nicht durch die Beschreibung gestützt. Auf Seite 5 (Z. 10-13) handelt es sich nur um Zusammensetzungen, nicht aber um Verbindungen A(B)-C gemäß des Anspruchs 1.



mindestens eine Verbindung der allgemeinen Formeln A-C, wobei

5

В

A eine Aminosäure mit mindestens einer funktionellen Gruppe in der Seitenkette ist,

B eine chemische Verbindung ist, die kovalent an mindestens eine funktionelle Gruppe in der Seitenkette von A gebunden ist, nämlich Oligopeptide mit einer Kettenlänge von bis zu 20 Aminosäuren, Polyethylenglykole mit Molmassen von bis zu 20000 g/mol, gegebenenfalls substituierte organische Amine, Amide, Alkohole, Säuren oder Aromaten mit 8 bis 50 C-Atomen,

- Ceine Thiazolidin-, Pyrrolidin-, Cyanopyrrolidin-, Hydroxyprolin-, Dehydroprolin- oder
  Piperidingruppe ist, die in Amidbindung mit A vorliegt, wobei

  H-Glu [NH(CH2)] CONH(CH2)] NH2] pyrrolidide und
  H-Lys [CO (CH2)] NHSD2 Pfp] pyrrolidide auspenommen Wilden,
  sowie
- 20 mindestens ein auf den Wirkort abgestimmtes übliches Adjuvans enthält.
  - 16. Pharmazeutische Zusammensetzung nach Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, daß A eine lpha-Aminosäure ist.
- 25 17. Pharmazeutische Zusammensetzung nach einem der Ansprüche 15 bis 16, dadurch gekennzeichnet, daß A eine natürliche α-Aminosäure ist.
  - 18. Pharmazeutische Zusammensetzung nach einem der Ansprüche 15 bis 17, dadurch gekennzeichnet, daß die Aminosäure Threonin, Tyrosin, Serin, Arginin, Lysin, Asparaginsäure, Glutaminsäure oder Cystein ist.
  - 19. Pharmazeutische Zusammensetzung nach einem der Ansprüche 15 bis 18, dadurch gekennzeichnet, daß die Oligopeptide Kettenlängen von 3 bis 15 Aminosäuren aufweisen.



30